

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
27. Januar 2005 (27.01.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
**WO 2005/007139 A2**

(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: **A61K 9/26**

(21) Internationales Aktenzeichen: **PCT/EP2004/007882**

(22) Internationales Anmeldedatum:  
15. Juli 2004 (15.07.2004)

(25) Einreichungssprache: **Deutsch**

(26) Veröffentlichungssprache: **Deutsch**

(30) Angaben zur Priorität:  
103 32 160.8 15. Juli 2003 (15.07.2003) **DE**

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von  
US): **RÖHM GMBH & CO. KG** [DE/DE]; Kirschenallee,  
64293 Darmstadt (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): **LIZIO, Rosario**  
[IT/DE]; Rossbergweg 7L, 64380 Rossdorf (DE). **PE-  
TEREIT, Hans-Ulrich** [DE/DE]; Händelstrasse 40,  
64291 Darmstadt (DE). **ROTH, Erna** [DE/DE]; Eber-  
städter Kirchstrasse 5, 64297 Darmstadt (DE). **DE  
ANDRES, Inés** [ES/BE]; Rue de Medaets 63, B-1150  
Woluwe St. Pierre (BE). **DAMM, Michael** [DE/DE];  
Dieburger Strasse 106, 63322 Rödermark (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für  
jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): **AE, AG, AL,  
AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH,  
CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES,  
FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,  
KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD,  
MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG,  
PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM,  
TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM,  
ZW.**

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für  
jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): **ARIPO (BW,  
GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG,  
ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU,  
TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK,  
EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT,  
RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA,  
GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).**

**Veröffentlicht:**

— ohne internationalen Recherchenbericht und erneut zu ver-  
öffentlichen nach Erhalt des Berichts

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Ab-  
kürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Co-  
des and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der  
PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: **MULTIPARTICLE PHARMACEUTICAL DOSAGE FORM CONTAINING A MUCOADHESIVELY FORMULATED  
PEPTIDE OR PROTEIN ACTIVE SUBSTANCES METHOD FOR PRODUCING SAID PHARMACEUTICAL DOSAGE FORM**

(54) Bezeichnung: **MULTIPARTIKULÄRE ARZNEIFORM, ENTHALTEND MUCOADHÄSIV FORMULIERTE PEPTID-  
ODER PROTEIN-WIRKSTOFFE, SOWIE EIN VERFAHREN ZUR HERSTELLUNG DER ARZNEIFORM**

(57) Abstract: The invention relates to an oral, multiparticle pharmaceutical dosage form containing pellets, the size of which ranges from 50 to 2500  $\mu\text{m}$  and which essentially consist of: a) an inner matrix layer containing an active substance which is a peptide or a protein, including the derivatives or conjugates thereof, and which is embedded in a matrix consisting of a polymer with mucoadhesive effect, and b) an outer film coating essentially consisting of an anionic polymer or copolymer, which can be optionally formulated with pharmaceutically conventional adjuvants, more particularly softening agents.

(57) Zusammenfassung: Die Erfindung betrifft eine orale, multipartikuläre Arzneiform, enthaltend Pellets mit einer Größe im Bereich von 50 bis 2500  $\mu\text{m}$ , die im wesentlichen aufgebaut sind aus a) einer inneren Matrix-Schicht, enthaltend einen Wirkstoff, der ein Peptid oder ein Protein einschließlich deren Derivate oder Konjugate ist und in eine Matrix aus einem Polymeren mit mucoadhaesiver Wirkung eingebettet ist, und b) einem äußeren verfilmten Überzug, bestehend im wesentlichen aus einem anionischen Polymer oder Copolymer, das optional mit pharmazeutisch üblichen Hilfsstoffen, insbesondere Weichmachern, formuliert sein kann.

WO 2005/007139 A2